

特許協力条約

P C T

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

REC'D 20 OCT 2005

WIPO PCT

(法第 12 条、法施行規則第 56 条)
〔P C T 36 条及びP C T 規則 70〕

出願人又は代理人 の書類記号 HP264	今後の手続きについては、様式P C T / I P E A / 4 1 6 を参照すること。	
国際出願番号 P C T / J P 2 0 0 4 / 0 1 7 4 9 0	国際出願日 (日.月.年) 25. 11. 2 0 0 4	優先日 (日.月.年) 25. 11. 2 0 0 3
国際特許分類 (I P C) Int.Cl. ⁷ A61K31/675, A61P7/10, 9/00, 9/04, 9/06, 9/10, 13/12, 25/04, 25/08, 29/00, 43/00		
出願人（氏名又は名称） 日産化学工業株式会社		

<p>1. この報告書は、P C T 35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条 (P C T 36 条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>6</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 指定されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (P C T 規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input checked="" type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第 802 号参照)</p>
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <ul style="list-style-type: none"> <input checked="" type="checkbox"/> 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎 <input checked="" type="checkbox"/> 第 II 欄 優先権 <input checked="" type="checkbox"/> 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 <input checked="" type="checkbox"/> 第 IV 欄 発明の單一性の欠如 <input checked="" type="checkbox"/> 第 V 欄 P C T 35 条 (2) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 <input checked="" type="checkbox"/> 第 VI 欄 ある種の引用文献 <input checked="" type="checkbox"/> 第 VII 欄 国際出願の不備 <input checked="" type="checkbox"/> 第 VIII 欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 15. 06. 2005	国際予備審査報告を作成した日 05. 10. 2005
名称及びあて先 日本国特許庁 (I P E A / J P) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 榎本 佳子 電話番号 03-3581-1101 内線 3452
	4 C 3229

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- この報告は、_____語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
 PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
 PCT規則12.4にいう国際公開
 PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。（法第6条（PCT14条）の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。）

- 出願時の国際出願書類

- 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

- 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

- 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

- 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. 補正により、下記の書類が削除された。

- 明細書 第 _____ ページ
 請求の範囲 第 _____ 項
 図面 第 _____ ページ/図
 配列表（具体的に記載すること） _____
 配列表に関するテーブル（具体的に記載すること） _____

4. この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかつたものとして作成した。（PCT規則70.2(c)）

- 明細書 第 _____ ページ
 請求の範囲 第 _____ 項
 図面 第 _____ ページ/図
 配列表（具体的に記載すること） _____
 配列表に関するテーブル（具体的に記載すること） _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

国際出願全体

請求の範囲 18

理由：

この国際出願又は請求の範囲 18 _____ は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。
請求の範囲 18 は、人の身体の手術又は治療による処置及び診断方法に該当するものである。

明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

全部の請求の範囲又は請求の範囲 _____ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

請求の範囲 18 _____ について、国際調査報告が作成されていない。

ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

提出されていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

所定の基準を満たしていない。

提出されていない。

所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

提出されていない。

所定の技術的な要件を満たしていない。

詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 <u>8-10</u>	有
	請求の範囲 <u>1-7, 11-17, 19</u>	無
進歩性 (IS)	請求の範囲 <u>8-10</u>	有
	請求の範囲 <u>1-7, 11-17, 19</u>	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 <u>1-17, 19</u>	有
	請求の範囲 _____	無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

- 文献1 : WO 03/062201 A1 (VITTAL MALLYA SCIENTIFIC RESEARCH FOUNDATION) 2003. 07. 31
 文献2 : Kenji Harada, Clinical Efficacy of Efondipine Hydrochloride, a T-type Calcium Channel Inhibitor, on Sympathetic Activities, Circulation Journal, 2003, Vol. 67, Issue 2, Pages 139-145
 文献3 : P. PHANI KUMAR, Synthesis and Evaluation of a New Class of Nifedipine Analogs with T-Type Calcium Channel Blocking Activity, Molecular Pharmacology, 2002, Vol. 61, No. 3, Pages 649-658
 文献4 : JP 60-69089 A (日産化学工業株式会社) 1985. 04. 19
 文献5 : JP 63-233992 A (日産化学工業株式会社) 1988. 09. 29
 文献6 : JP 1-275591 A (日産化学工業株式会社) 1989. 11. 06
 文献7 : 鈴木洋通, シルニジピンの腎硬化症を伴う高血圧患者の降圧および尿蛋白減少効果, Therapeutic Research, 2000, Vol. 21, No. 4, Pages 760-762
 文献8 : D. Bilici, Protective Effect of T-type Calcium Channel Blocker in Histamine-induced Paw Inflammation in Rat, Pharmacological Research, 2001, Vol. 44, No. 6, Pages 527-531
 文献9 : Chris Baylis, Comparison of L-Type and Mixed L-and T-Type Calcium Channel Blockers on Kidney Injury Caused by Deoxycorticosterone-Salt Hypertension in Rats, American Journal of Kidney Diseases, 2001, Vol. 38, No. 6, Pages 1292-1297
 文献10 : William F. McCalmont, Design, synthesis, and biological evaluation of novel T-Type calcium channel antagonists, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2004, Vol. 14, No. 14, Pages 3691-3695
 文献11 : Darrell M. Porcello, Actions of U-92032, a T-Type Ca^{2+} Channel Antagonist, Support a Functional Linkage Between I₊ and Slow Intrathalamic Rhythms, J Neurophysiol., 2003, Vol. 89, No. 1, Pages 177-185

(i) 請求の範囲 1-4, 11-17, 19 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1より新規性及び進歩性を有しない。

文献1には、式I及びIIで示される化合物がT型カルシウムチャネルを阻害する旨、カルシウムチャネル阻害作用に関連する疾患の治療に有用である旨記載されている（請求項1-54及び実施例18）。

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則 70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日.月.年)	出願日 (日.月.年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日.月.年)
WO 2004/024153 A2 「EX」	25.03.2004	11.09.2003	12.09.2002

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則 70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日.月.年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日.月.年)

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

(i i) 請求の範囲 1, 5 – 7, 15 – 17, 19 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 2 より新規性及び進歩性を有しない。

文献 2 には、Efondipine が T 型カルシウムチャネルを阻害する旨記載されており、高血圧、狭心症等に有効である旨記載されている (Abstract)。

(i i i) 請求の範囲 1, 11 – 14 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 3 より新規性及び進歩性を有しない。

文献 3 には、PPK17, PPK18 等が記載されており、該化合物が T 型カルシウムチャネルを阻害する旨記載されている (ABSTRACT, TABLE1)。

(i v) 請求の範囲 15 – 17, 19 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 4 – 7 より新規性及び進歩性を有しない。

文献 4 – 6 には、それぞれ一般式 (I) で示される化合物が、平滑筋及び心筋の収縮を抑制させ、冠疾患、狭心症、高血圧等に有効である旨記載されている (文献 4 の請求項 1 及び第 5 頁左上欄第 12 ~ 14 行, 文献 5 の請求項 1 – 5 及び第 2 頁右上欄下から 8 ~ 6 行, 文献 6 の請求項 1 – 8 及び第 2 頁左上欄第 10 ~ 14 行)。また、文献 7 には、シルニジピンが腎硬化症を伴う高血圧患者の収縮期血圧・拡張期血圧を下降させる旨記載されている ('はじめに' 及び '2 結果と考察')。

(v) 請求の範囲 15 – 17, 19 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 1 – 3, 8 – 11 より進歩性を有しない。

文献 8 – 11 には、T 型カルシウムチャネル阻害剤が、炎症、腎障害、ガン、てんかん等に有効である旨記載されている (文献 8 – 11 の ABSTRACT)。

したがって、T 型カルシウムチャネル阻害作用を有する、文献 1 – 3 に記載された化合物を、炎症、腎障害、ガン、てんかん等の治療に用いることは、当業者が容易に想到し得ることであり、当該事項による格別の効果も認められない。

(v i) 請求の範囲 8 – 10 に係る発明は、国際調査報告に記載された何れの文献にも開示されておらず、新規性及び進歩性を有する。特に、式 (1) で表される化合物のうち、含窒素ヘテロ環部分がピリジン環であり、そして Z が、式 (2) で表される基である化合物が、T 型カルシウムチャネル阻害作用を有することは、最も関連のある先行技術文献であると認められる文献 1 – 11 にも開示されていない。